(19) 日本国特許庁 (JP)

① 特許出願公開

⑩ 公開特許公報(A)

昭58—49387

Int. Cl.3

識別記号

庁内整理番号 7169-4C

砂公開 昭和58年(1983) 3 月23日

発明の数 2 審査請求 未請求

(全 15 頁)

C 07 D 501/57 // A 61 K 31/545

ADZ

図7ーメトキシセフアロスポリン化合物および その製法

②特 願 昭56—146900

22出 願 昭56(1981)9月17日

⑫発 明 者 渡辺泰一郎

東京都品川区広町1丁目2番58 号三共株式会社化学研究所内

明 者 タケル・ヒグチ ⑫発

> アメリカ合衆国カンサス州ロー レンス・シユウオーツ・ロード

2811

者 ヴアレンテイノ・ジエイ・ステ ラ

> アメリカ合衆国カンサス州ロー レンス・サンセツト・ドライヴ 777

⑩出 願 人 三共株式会社

東京都中央区日本橋本町3丁目

1番地の6

⑩代 理 人 弁理士 樫出庄治

キシセフアロスポリン化 その製法

- - 1. 式

を示し、R2はアルキル基、アルケニル基、アル 中ニル基、アルコキシアルキル基、オキソアル 中ル基またはR⁵A-基(式中、R⁵は脂環式アルキ ル基、ヘテロ脂環式アルキル基、アリール基ま たはヘテロアリール基を示し、Aは単結合また はアルキレン基を示す。)を示す。]で扱わさ れる化合物。

(式中、Ⅱは水素原子、アルカリ金属または アミンの塩を示す。)を有する化合物に

「式中、エはハロゲン原子を、R'は水素原子 または低級アルキル基を示し、R2はアルキル基、 アルゲニル基、アルキニル基、アルコキシアル キル基、オキツアルキル基またはR⁵A 一基(式 中、R⁵は脂環式アルギル基、ヘテロ脂環式アル キル基、アリール基まだはヘテロアリール基を 示し、」は単語合せたはアルデジン芸を示す。) を示す。〕を有する化合物を反応させることを 特徴とする 式

2 式

(式中、R¹およびR²は前配と同一意義を有す。) で表わされる化合物の製法。

3. 発明の詳細な説明

本発明は 式

「式中、R¹は水米原子または低級アルキル基を示し、R²はアルキル基、アルケニル基、アルケニル基、アルカー基、アルカー基、オキソアルキル基またはR⁵A -基(式中、R⁵は脂類式アルキル基、ヘテロ脂環式アルキル基、アリール基

収が非常によく、且つ吸収後速やかに加水分解され治療に必要な充分高い血中濃度が得られる事を見出した。

本発明の化合物(I)は常法例えばセフメタゾール又はその塩例えばナトリウム塩又はオニウム 塩例えばアンモニウム塩を式

(式中、R¹。R²は前配定義と同様、xはハロゲン原子例えば塩素、臭素又は沃素を示す。)を有する化合物と反応させることにより製造いる多が出来る。反応溶媒は反応に関与しないするのであれば限定なく使用出来るがスルホキサイド、があるはジメチルスルホキサイド、メージ置換アミド類例えばドージメチルル類のえばアセトニトリル、エーテル類例えばアセトニトリル、エーテル類例えばアセトニトリル、エーテル類例えばアセトニトリル、カン類のえばジクロルメタン等が使用され、更に好適なものとして

またはヘテロアリール基を示し、▲は単結合ま たはアルキレン基を示す。)を示す。〕を有す る化合物およびその製法に関するものである。

本発明の前記(I)で表わされる7 αーメトキシセフアロスポリン化合物は新規化合物で、経口吸収性抗菌剤として有用な化合物である。

本化合物は既にザ・ジャーナル・オブ・アンチパイオテイツクス 29巻 554 買乃至 558 頁(187 8年)に報告されている福めて抗協活性の強い 7 ーメトキシセファロスポリン化合物でセフメタゾールと呼ばれている 7 月ーション・ステル・フェー・ステルー 1 ーメチルー 1 ヨーテトラゾールー 5 ーイルチオナル)ー 3 ーセフェムー 4 ーカルボ 0 に 1 ーメチル)ー 3 ーセフェムー 4 ーカル 2 で 2 メタゾール及びその塩例えばナトリウム塩は主として注射剤として有用である。

本発明者らはセフメタゾールの有用な経口投与剤の研究を重ねた結果、上記(I)式で表わされるセフメタゾールのエステルが消化管からの吸

はジメチルスルホキサイドがあげられる。反応 温度は特に限定はないが通常 0 ℃乃至 2 5 ℃の 間が便利である。反応時間は反応温度、溶鉄、 反応試楽によつて一定ではないが、通常 5 分乃 至 6 0 分の間で行うのが好適である。

本発明において出発物質としてセフメタゾールの遊離のカルボン酸が使用される場合には反応を塩基例えば設酸ナトリウム、炭酸カリウムのような無機弱塩基、トリエチルアミンのような有機塩基或いは当量のナトリウムアルコラート、水酸化ナトリウム等の存在下実施する事が好ましい。通常遊離カルボン酸を一旦塩の型にかえて使用する方が好適である。

式(2)で示される化合物は×が塩素、臭素、沃 素原子のいずれでも使用されるが臭素原子また は沃素原子が好適であり×が塩素原子で示され る化合物を使用する場合は臭化ナトリウム或い は沃化ナトリウムの存在下又はこれらの化合物 で前処理後使用する事も出来る。本反応におい ては式(2)で示される化合物は出発物質に対し当 モル乃至 2 倍モル量使用される。反応終了後、 1.5 乃至 2 倍モル量使用される。反応終了後、 目的化合物は常法により採取される。例えば酢 鍛エチルのような水と退らない有機溶媒を加え 水洗後、有機溶媒を留去し、必要なら再結晶又 はクロマトグラフィーによつて精製する。

また、本発明の化合物(1)はセフメタゾールー
1 ーオキサイドのカルボン酸を原料として、前
3 したセフメタゾールのカルボン酸のエステル
化反応と同様処理を行つた後、得られたセフメ
タゾールー1 ーオキサイドのエステルを常法に
グールー1 ーオキサイドのエステルを常法に
さった遊元処理、例えばアセチルクロライドー
ョウ化カリウム処理に付し、製造することがで
きる。

以上のどとくして得られる本発明の式(I)で示される化合物としては 式

ずれか 1~4個を含有するヘテロアリール基であり、Aは単結合または例えばメチレン、エチレン、エチリアン、プロピレン、プロピリアンのような直鎖状若しく分枝鎖状のアルキレン基である化合物」を当けることができる。

超適の化合物は次の如き化合物である。

- (I) 1 1 1 1 2 2 7 1 メチルチオアセトアミドー1 ローメトキシー3 (1 メチルー 1 H テトラゾールー 5 イルチオメチル) 3 セフェムー4 カルボン酸(以下 C M Z の略号を用いる)エトキシカルボニルオキシメチルエステル
- (2) OMZnープロピルオキシカルボニルオキ シメチルエステル
- (3) C M Z イソプロピルオキシカルボニルオ キシメチルエステル
- (4) CMZ ロープチルオキシカルボニルオキ シメチルエステル
- (5) C M Z 1 プチルオ中シカルポニルオキ シメチルエステル

において、Riは好道には水素原子または例えば メチル、エチルまたはプロピル基のような低級ア ルキル基であり、R2は炭素数1~10の直鎖状 若しくは分枝鎖状のアルキル基、二重結合を1 ~ 2個含有する炭素数3~10の直鎖状若しく は分枝鎖状のアルケニル法、三重結合を1~2 個合有する炭素数3~10の直鎖状若しくは分 枝鎖状のアルキニル基、炭紫数3~10からな る直鎖状若しくは分枝鎖状のアルコキシアルキ ル基、炭条数3~10からなるオ中ソアルャル 基、またはR⁵A 一路(式中、R⁵は二重結合を1 個合有してもよい炭米数3~7の脂環状アルキ ル苦、嵌条、盤果、硫黄のいずれか1~8個を 合有し二重結合1個を有してもよい3員~7員 **数状のヘテロ脳蛋式アルキル器、例えばメチル、** エチルのような低級アルキル基、例えば弗素、 塩果、臭素のようなハロゲン原子例えばメトキ シ、エトキシのような低級アルコキシ基、アミ ノ善またはカルボキシル基を有するか有しない アリール港、または酸素、窒素、硫黄原子のい

- (6) CMZ。 tープチルオキシカルポニルオキシメチルエステル
- (7) C M Z ローペシチルオキシカルポニルオキシメチルエステル
- (8) CMZ 3ーメチルプチルオキシカルポニ ルオキシメチルエステル
- (9) CMZ 1,1ージメチルプロピルオキシカルポニルオキシメチルエステル
- 04 C M Z 2 2 2 ジメチルプロピルオキシカ ルポニルオキシメチルエステル
- 65 CMZ ローヘキシルオキシカルポニルオ キシメチルエステル
- 03 0 M Z 1 エチルプロピルオキシカルボ ニルオキシメチルエステル
- 64 CMZ 3.3 ジメチルプチルオキシカル ボニルオキシメチルエステル
- Q4 Q M Z 4 メチルペンチルオキシカルボ ニルオキシメチルエステル
- 09 CMZ ローヘプチルオ中シカルポニルオ キシメチルエステル

A

- 16 C M Z ローオクチルオキシカルポニルオ キシメチルエステル
- 07 CM2 1-エトキシカルボニルオキシエ チルエステル
- 18 CMZ 1-n-ブチルオキシカルポニル オキシエチルエステル
- 19 C M Z 1 (2 2 ジメチルプロピルオ キシカルポニルオキシ)エチルエステル
- O CMZ 1-n-ペンチルオキシカルポニ ルオキシエチルエステル
- Q1 0 M Z 1 n ヘキシルオキシカルボニ ルオキシエチルエステル
- 口 CM2 1-ローヘプチルオキシカルボニ ルオキシエチルエステル
- CMZ アリルオキシカルボニルオキシメ チルエステル
- OM CMZ 1-ピニルプロピルオキシカルボ ニルオキシメチルエステル
- の OM Z 1ービニルプチルオキシカルボニ ルオキシメチルエステル
 - ニルオキシメチルエステル
- (39) C M Z 3 エトキシプロピルオキシカル ボニルオキシメチルエステル
- (f) C M Z プロペルギルオキシカルボニルオ キシメチルエスデル
- 図 CM2 1-エチニルプロピルオキシカル ポニルオキシメチルエステル
- OM CM Z ペンジルオキシカルボニルオキシ メチルエステル
- (40) C M Z フェノキシカルポニルオキシメチ ルエステル
- (41) CMZ 3ーテトラヒドロフリルオキシ カルポニルオキシメチルエステル
- (42) OMZ 3-フリルメチルオキシカルボ ニルオキシメチルエステル
- (43) CMZ 1ーテトラヒドロフルフリルオ キシカルポニルオキシエチルエステル
- (44) CMZ フルフリルオキシカルポニルオ キシメチルエステル
- (45) OMZ 4ーテトラヒドロピラニルオキ

- O CMZ 2-ヘキセン-1-イルオキシカ ルポニルオキシメチルエステル
- の CM2 1、1-ジメチルー2ープロペンー 1-イルオキシカルポニルオキシメチルエス テル
- OM OM Z 1 ピニルー3 プテンー1 イ ルオキシカルボニルオキシメチルエステル
- C M C M Z シクロプロピルメチルオキシカル ポニルオキシメチルエステル
- ON CM2 1-シクロプロピルエチルオキシ カルポニルオキシメチルエステル
- 60 CMZ シクロプチルメチルオキシカルポ ニルオキシメチルエステル
- ON ON 2 シクロペンチルオキシカルボニル・ オキシメチルエステル
- (3) OMZ シクロペンチルメチルオキシカル ポニルオキシメチルエステル
- 64 CMZ シクロヘキシルオキシカルボニル オキシメチルエステル
- 田 CMZ 4ーオキソペンチルオキシカルボ

シカルポニルオキシメチルエステル

- (46) CMZ 2ーテトラヒドロピラニルメチ ルオ中シカルボニルオキシメチルエステル
- (47) CMZ 5.6 ジヒドロー 2 日 ピラン - 3 - イルメチルオキシカルボニルオキシメ チルエステル

本発明の化合物は単独又は薬学的に許容される賦形剤(例えばデンプン、乳糖、炭酸カルシウムなど)、結合剤(例えばアラピアゴム、カルボキシメチルセルロースなど)、滑沢剤(例えばタルク、ステアリン酸マグネシウム等)を混合して常法によりカブセル剤、錠剤、顆粒剤等として経口投与する。

投与監は成人に対し1日量として 0.3~59 好ましくは1~39を3~4回に分けて与える 事が出来る。

次に本発明の参考例(原料の製造例)及び実施例を示す。本発明はこれによつて何ら限定されるものではない。

参考例 1

クロロメチル 3-フリルメチルカーポネー

3-フランメタノール(0.86 紀)をメチレン クロライド(10 配) に密かし氷冷下にピリジン (0.87 ≈)を加え、次いでクロロメチルクロロ ホルメート(0.35 ml)を加える。氷冷下に 3 0 分間攪拌した後室温で一晩攪拌する。反応液の メチレンクロライドを留去し得られる油状物を エチルアセテートと水に溶かしエチルアセテー ト溶液を10%塩酸、水、飽和重曹水、水の順 で洗い無水硫酸マグネシウムで乾燥する。酢酸 エチルを留去すると目的物(1.528 8)が得られ 、た。

NMR スペクトル (CDCLs) 0 ppm:

507 (一重額, 2日)

570 (一重線, 2日)

6.45 (プロード一重盤。1 H)

7.28 - 7.82 (多重額, 2 日)

参考例 2

ヨードメチル ミーフリルメチルカーポネー ŀ

台考例1で得られたクロルメチル ルメチルカーポネート(1.528 8)をアセトン ·(20 ml) に裕かしョウ化ナトリウム(80 8)を 加え宮温で一晩機伴する。反応液のアセトンを 留去し得られる幾渣を酢酸エチルと水に溶かす。 酢酸エチル層を分離し10多の二亜硫酸ナトリ ウム水溶液、水の順で洗り。酢酸エチルを硫酸 マグネシウムで乾燥後、留去すると目的物 (1.951 8)が得られた。

NMR スペクトル (CDCLs) δ ppm:

5.08 (一重驗, 2日)

5.82 (一重線, 2 H)

8.45 (プロード一重線,1 H)

7.30 - 7.60 (多重級, 2 H)

参考例 3

カーポネート

21-ジメチループロパン・1-オール (0.944 8) をメチレンクロライド(10 配) に答 かし氷冷下にピリジン(087 W)を加え、次い で1-クロロエチルクロロホルメート(1.3 心) を加える。氷冷下に30分間攪拌した後室温で 一晩攪拌する。メチレンクロライドを留去して 得られる残渣を酢酸エチルと水に溶かし酢酸エ チル抽出する。酢酸エチル層を108塩酸、水、 飽和重曹水、水の順に洗い、硫酸マグネシウム で乾燥する。酢酸エチルを留去すると目的物

NMR スペクトル (CDCL₅) δ ppm :

0.97 (一重線, 9 H)

1.85 (二重線 , 3 H ; J = 6.0 Hz)

3.92 (一重線, 2 H)

6.48 (四重艇,1 H;J = 6.6 Hg)

台考例3で得られる1-クロロエチル ジメチルブロビルカーポネート(1.9 8) をアセ トン(20 m)に浴かしョウ化ナトリウム(888) - を加え室温で一晩攪拌する。アセトンを留去し て得られる残渣を酢酸エチルと水に溶かし酢酸 エチル層を106二亜硫酸ナトリウム、水の順 **に洗い硫酸マグネシウムで乾燥する。硫酸マグ** ネシウムを严去し酢酸エチルを留去すると目的 物と出発物質の1:1の混合物(1.6 8)が得ら れた。この混合物を精製することなく次の反応 に用いる。

NMR スペクトル (CDCL3) 8 ppm:

0.97 (一重線,9里)

2.23 (二重線, 3 H; J = 8.0 Hg)

3.90-(一重線,2月)

6.73 (四重線, 1 H; J = 6.0 Hz)

参考例 4

実施例1

1-ヨードエチル 2.2-ジメチルプロピル 18-シアノメチルチオアセトアミド-Ια

- メトキシー8(1-メチル-1H-テトラゾ) ールー5-イルチオメチル)-3-セフエム-4-カルポン酸 3-フリルメチルオキシカル ポニルオキシメチルエステル

参考例 2 で得られたヨードメチル 3 - フリ ルメチルカーポネート (1.528 8)を DMF に裕か し、セフメタソール (0.5 g) の DMF (2 ml + 1 11) 溶液を室温で加え10分間反応させる。反 応液を氷水にあけ酢酸エチルで抽出する。酢酸 エチル層を10多二亜硫酸ナトリウム、水の顔 で洗い硫酸マグネシウムで乾燥する。酢酸エチ ルを留去して得られる油状物をシリカゲル(20 8)カラムクロマトにかけへキサン/酢酸エチ ルニ 1/2 で密出する部分から目的物(0459 8) が得られた。

NMR スペクトル (CDCL₅) 8 ppm: 855 (一重級,7月) 3.67 (プロードー重線,2日) 3.92 (一重線, 3 日) 420 (二重線,1 H; J = 140 Hz)

酢酸エチル抽出する。酢酸エチルを10岁二亜 **伽酸ナトリウム、水の順に洗い硫酸マグネシウ** ムで乾燥する。硫酸マグネシウムを沪去し酢酸 エチルを留去すると油状物が得られる。この油 状物をシリカゲル(208)クロマトにかけへキ -メトキシー3(1-メチルー1日-テトラゾ サン/酢酸エチル=1/2 で格出する部分から得 られる油状物を薄眉クロマトにかけへキサン/ 酢酸エチル= 1/2 で展開し Rt 値の小さい方の 部分から目的物(0042 8)が得られた。

NMR スペクトル (CDCLs) ð ppm:

0.87 (一重級,9出)

1.65 (二重線, 3 H; J = 6.0 Hg)

336 (プロード一重線,2 H)

353 (一重般,7日)

385 (一重級, 2 日)

3.90 (一重線, 3 H)

420 (二重線,1 H; J=14.0 Hz)

4.60 (二重線, 1 H; J = 14.0 Hz)

5.03 (一重線,1H)

697 (四重線、1 H; J = 6.0 Hz)

、443 (ブロード一重線 , 1 日) 4.57 (二重線,1 H : J = 140 Hg) 5.05 (一重線, 1 H) 5.10 (一重線, 2 日) 5.85 (二重線 , 1 H ; J = 8.0 Hz) 5.98 (二重般 , 1 H ; J = 6.0 Hz) 7.20 - 7.60 (多重線, 2 日) 7.67 (プロードー重組、1 日)

实施例 2

7 β - シアノメチルチオアセトアミドー 7 α 4-カルポン酸 1-(22-ジェチルプロピ ルオキシカルポニルオキシ)エチルエステル 参考例 4 で得られた 1 - ヨードエチル 2.2 - ジメチルプロピルカーポネート(1.B *9*)を DMP (2×) に溶かしこれにセフメタゾール (0.5 8)の DMF (2 m + 1 ml)の溶液を加え室 個で10分間反応させる。反応液を氷水にあけ

7.53 (プロード一重線 , 1 日)

*18-シ*アノメチルチオアセトアミド-1α ール・5 - イルチオメチル) - 3 - セフエム・ 4-カルボン酸 1,1-ジメチルプロピルオキ シカルポニルオキシメチルエステル

参考例1と同様な方法で合成したクロロメチ ル 1,1-ジメチルプロピルカーボネート(1.01 9)をDMF(2 ml)に絡かし室温でセフメタソ ールの1-8オキサイド(0.490 8)のトリエチ ル T ミ ン (140 AL) の DMF (4 ml) 溶 液 を 加 え 室温で一晩攪拌する。反応液を氷水にあけ酢酸 エチルで抽出する。酢酸エチルを水で洗い硫酸 マグネシウムで乾燥する。硫酸マグネシウムを **严去し酢酸エチルを留去して得られる油状物を** シリカグル(208)カラムクロマトにかけ酢 酸エチルで溶出する部分から8-オキサイドエ ステル (0.238 8) が得られる。この 8 - オキサ

イドエステルを DMF(5g)に溶かし氷冷下に ヨウ化カリウム(0.89 8)、アセチルクロライ ド (0.160 €) の順で加え 4 時間氷冷下に反応さ せる。反応液を氷水にあけ酢酸エチル抽出する。 酢酸エチルを106二亜硫酸ナトリウム、水、 10 多塩酸、水、飽和重曹水、水の順に洗い砒 酸マグネシウムで乾燥する。硫酸マグネシウム を沪去し酢酸エチルを留去すると油状物が得ら れる。これをシリカゲル(128)カラムクロ マトにかけヘキサン/酢酸エチルニ 1/2 で溶出 する部分から目的物(0134 8)が炎黄色粉末と して得られた。

1

NMR スペクトル (CDCL3) ð ppm: 0.92 (三重線, 3 H; J = 7.0 Hg) 1.47 (一重線 , 6 日) 248 (四重級, 2 R; J = 7.0 Hg) 857 (一重線,7日) 3.65 (プロード一重線: 2 日) 3.93 (一重線, 3 H)

423 (二重般, 1 H; J = 140 Hz)

'423 (二重線, 1 H; J=140 Hz) 428 (四重般, 2 H; J = 6.0 Hz) 480 (二重般, 1 H; J = 140 Hz) 5.08 (一重線,1 H) 5.87 (プロード一重線, 2.日) 7.57 (プロード一重線,1 日) $R^1 = H \cdot R^2 = CH_2(CH_2)_3 OH_5$ NMR スペクトル (CDCL₈) ð ppm : 0.80 (三重級, 8 H; J = 6.0 Hg) 5.05 (一重級, 1 H) 1.05 - 200 (多重線, 8 H) 357 (一重額,7日) 387 (プロード一重銀,2日) 393 (一重額, 3 H) 417 (二重線 , 1 H; J = 140 Hz) 420 (三重線, 2 H; J = 60 Hg) 5.07 (一重線,1 H) 588 (プロード一直線 , 2 日) 7.83 (プロード一重線,1月) $R^1 = H \cdot R^2 = CH(CH_5)_2$

457 (二重額,1 H; J = 140 Hg) 503 (一重額,1日) 587 (プロード一重級, 2 H) 7.68 (プロードー重級、1 日)

実施例2または3と同様にして以下の構造式 で示したセフエムカルポン酸エステル誘導体を セフメタソールまたはセフメタソールの1-B オキサイドと相当するハライドより合成した。

 $R^1 = H \cdot R^2 = CH_2CH_3$ NMR スペクトル (CDCLx) 8 ppm: 1.88 (三重隸, 8 H; J = 60 Hg) 358 (一重報,7日) 170 (プロード一重線 , 2 日) 397 (一重線, 8 日)

NMR スペクトル (CDCLs) 8.ppm: 1.32 (二重服 6 H ; J = 6.0 Hz) 357 (一重級,7日) 387 (プロード一重般, 2 日) 893 (一重線, 3 日) 430 (二重線、1 H; J= 140 Hg) 457 (二重線,1 H; J= 140 Hg) 493 (七重線、1 H: J = 80 Hg) 5.9.0 (プロード一重線 , 2 日) 7.43 (プロード一重線 , 1 日) $R^1 = H , R^2 = C(CH_5)_5$ NMR スペクトル (CDC43) 8 ppm: 1.50 (一重線,9日) 8.57 (一重粮,7日) 390 (一重額。3円) 427 (二重線, 1 H; J = 140 Hg) 457 (二重額,1 H; J=140 Hz) 5.07 (一重額,1 日)

```
特開昭58- 49387 (8)
```

```
587 (プロードー直線,2 H)
                                      388 (プロード三重線 , 2 日 )
     7.57 (プロード一重線, 1 日)
                                       3.93 (一重額, 3 H)
  R^1 = H , R^2 = CH_2 - \langle \overline{O} \rangle
                                       418 (プロードー重線, 3 日)
    NMR スペクトル (CDCLs) 8 ppm:
                                       423 (二重線, 1 H; J = 14.0 Hg)
      3.12 (一重線, 2 日)
                                       457 (二重線,1 H; J=140 Hg)
     3.53 (一重線, 7日)
                                       5.07 (一重般, 1 H)
      363 (プロード一重線, 2 H)
                                       5.93 (プロード一重線 . 2 日)
                                       7.73 (プロードー重線,1 H)
      388 (一重組, 3 H)
                                R^1 = H, R^2 = CH_2(CH_2)_4CH_5
      420 (二重線, 1 H; J = 140 Hg)
      4.53 (二重線 1 H : J = 140 Hz )
                                    WMR スペクトル (CDCℓ3) δ ppm :
                                       0.92 (三重線, 3 H, J = 6.0 Hg)
      5.05 (一重線, 1 日)
      592 (プロード一重線, 2 日)
                                       1.13 - 2.20 (多重線 , 8 日 )
     7.33 (一重線,5日)
                                       358 (一重線,7日)
      7.33 (プロード一重線,1 日)
                                       168 (プロードー重線,2 H)
                                      3.95 (一重線, 3 H)
  R^1 = H , R^2 = CH,
                                       420 (三重線, 2 H; J = 8.0 Hg)
    NMR スペクトル (CDCLs) ð ppm:
                                       4.27 (二重級、1 B; J = 140 Hg)
  1.60 - 230 (多重額, 4 日)
                                       460 (二重線、1 H; J = 140 Hz)
     3.57 (一重線,7日)
                                    · 5.07 (一重線,1H)
     387 (プロード一重銀 , 2 日 )
                                       593 (プロード一重線,2月).
    7.40 (プロードー重線,1 H)
                                   · 457 (二重線、1 H; J = 140 Hg)
 R^1 = H , R^2 = CH_2(CH_2)_6 CH_5
                                     467 (多重線,1 H)
    0.90 (三重級, 3 H; J = 6.0 Hg)
                                     5.07 (一重線,1 日)
    1.03 - 200 (多重額, 12 日)
                                      5.93 (プロード一重線, 2 日)
                                      7.43 (プロード一重線,1 日)
     857 (一重般,7日)
     867 (プロードー重線, 2 日)
                                 R^1 = H \cdot R^2 = -\langle O \rangle
     3.93 (一重額, 3 日)
                                   NMR スペクトル (CDCLs) & ppm:
     420 (三重線, 2 H; J = 6.0 Hg)
                                  353 (一重線,7 日)
     428 (二重級,1 H; J = 140 Hg)
                                     365 (プロード一重線,2日)
     457 (二重線,1 H; J=140 Hz)
                                   3.88 (一重線, 3 日)
     507 (一重線, 1 H)
                                    422 (二重線,1 H; J = 140 Hg)
    592 (プロード一重報, 2 日)
                                     4.58 (二重線,1 H; J = 14.8 Hg)
    7.82 (プロード一重額,1 H)
                                      505 (一重線, 1 H)
R^{\dagger} = H , R^{2} = -
                                     588 (二重線, 1 H; J = 5.0 Hg)
   NMR スペクトル (CDCL3) ð ppm:
                                  6.08 (二重線,1 H; J = 5.0 Hz)
    1.00 - 240 (多重線 10 H)
                                     695 - 7.45 (多重額,5日)
    357 (一重般,7日)
                                    7.60 (プロード一重線,1円)
    367 (プロード一重線 , 2 日 )
                              R^{1} = H , R^{2} = CH_{2}C(CH_{5})_{5}
    398 (一重般, 3 H)
                                    NMR スペクトル (CDCL3) 8 ppm:
     427 (二重線,1 H; J=140 Hg)
                                      097 (一重般,9日)
```

```
特開昭58- 49387 (9)
   353 (一重線,7日)
                                       5.83 (プロードー 重線 , 2 H )
                                       7.87 (プロード一重級,1 日)
   3.65 (プロードー重級, 2 日)
   3.87 (一重線, 2 H)
                                   R^1 = H , R^2 = -
   392 (一重額, 3 H)
                                     NMR スペクトル (CDCL5) 8 ppm :
   4.20 (二重線,1 H; J=140 Hg)
                                    1.43 - 1.83 (多重額,8日)
   4.55 (二重線,1 H; J=140 Hz)
                                       3.55 (一堂絵,7日)
                                       3.67 (プロード一重般, 2 日)
   5.03 (一重級,1日)
   5.92 (プロードー重線, 2 出)
                                       393 (一重線, 3 H)
                                       407 (二重線,1 H;J=140 Hg)
   7.65 (プロードー重線,1 H)
R^1 = H , R^2 = CH_2(CH_2)_5 CH_5
                                       4.57 (二重銀,1 H;J=14J Hg)
 NMR スペクトル (CDCLa) δ ppm:
                                       5.08 (一重線,1 H)
   0.98 (三重線, SH; J = 6.0 Hz)
                                  5.08 (プロード多重級, 1 H)
                                      5.88 (プロード一重般。2日)
   1.03 - 200 (多重線, 10 日)
                                      7.63 (プロードー重線, 1 H)
   3.57 (一重線,7H)
   3.67 (プロード一重線, 2 H)
                                  R^1 = H , R^2 = CH_2CH_2CH_2OCH_2CH_3
                                     BMR スペクトル (ODCLa) 8 ppm:
   3.93 (一重線, 3 H)
   418 (三重線, 2 H; J = 6.0 Hg)
                                     1.18 (三重線, 3 H: J = 6.0 Hg)
   4.20 (二重線, 1 H; J= 140 Hg)
                                 1.95 (五重線, 2 H; J = 6.0 Hg)
   460 (二重級 , 1 H; J = 140 Hg)
                                      3.45 (四重線, 2 H; J = 6.0 Hg)
   5.07 (一重線, 1 H)
                                       3.58 (一重線,7 H)
                                       5.07 (一重線,1用)
    3.58 (三重級。2 H; J = 6.0 Hg)
                                      5.95 (プロード一重般, 2 日)
    3.68 (プロード一重線, 2 円)
                                       7.72 (プロード一重線,1 日)
    397 (一重級, 3 H)
                                     R^1 = H , R^2 = CH_2
    4.25 (二重線, 1 H; J = 140 Hz)
                                       NMR スペクトル (CDCL<sub>5</sub>) 8 ppm:
    4.32 (三重級, 2 H; J = 6.0 Hg)
    4.61 (二重版, 1 H; J = 14.0 Hg)
                                        1.60 - 2.20 (多重般,7日)
                                        3.55 (一重線,7 H)
    5.08 (一重級, 1 H)
                                        3.67 (ブロードー重線, 2 H)
    5.95 (プロード一重線, 2 日)
    7.78 (プロード一重線,1円)
                                     · 3.93 (一重線, 3 H)
                                        417 (二重線, 2 H; J = 6.0 Hz)
 R^1 = H , R^2 = \frac{1}{CH_5}
                                        4.23 (二重線, 1 H; J= 14.0 Hg)
                                        4.57 (二重線, 1 H; J= 14.0 Hg)
  NMR スペクトル (CDCLs) ð ppm:
                                        5.05 (一重線.1 H)
    0.02 - 1.60 (多重級,5 H)
    1.42 (二重般, 3 H; J = 6.0 Hz)
                                        5.90 (プロードー重線, 2 H)
                                       7.63 (プロードー重般, 1 H)
    3.57 (一重線, 7 日)
                                    R^1 = H , R^2 = CH_2CH^{\pm}_3 CHCH2CH2CH3
    3.67 (プロード一重線, 2 日)
                                     NMR スペクトル (CDCL5) ð ppm:
    3.95 (一重艇, 3 日)
```

0.92 (三重線, 3 H; J = 6.0 Hg)

1.75 - 202 (多重般, 2耳)

1.35 (プロード六重線, 2 日; J = 8.0 Hz)

4.00 - 4.25 (多重線, 1 H)

4.25 (二重線, 1 H; J = 140 Hg)

4.58 (二重線, 1 H; J= 140 Hg).

```
特開昭58- 49387 (10)
   3.55 (一重緞,7日)
                                       5.90 (プロード一重線 . 2 日)
                                      7.77 (プロード一重般,1日)
   3.65 (プロードー重線, 2 日)
                                   R^1 = H , R^2 = -
   3.95 (一重額, 3 H)
   422 (二重級,1 H; J = 140 Hg)
                                     NMR スペクトル (CDCLs) 8 ppm:
   4.52 (二重般, 1 B; J = 140 Hz)
                                       247 (プロード三重線, 2 H; J = 7.0 Hg)
  460 (二重級, 2 H; J = 6.0 Hz)
                                       360 (一重線,7日)
   5.03 (一重献, 1 H)
                                       3.67 (プロード一直線,2日)
   5.25 - 6.02 (多重線, 2 日)
                                       3.93 (一重融, 3 H)
   5.88 (プロード一重般, 2 H)
                                       4.23 (二重線, 1 H; J= 140 Hg)
   7.65 (プロード一重線 1 日)
                                       4.57 (二重線, 1 H; J = 140 Hz)
R^1 = H, R^2 = CH_2
                                       4.80 - 6.05 (多重線,7日)
 NMR スペクトル (CDCLs) ð ppm:
                                       5.07 (一堆線,1H)
  1.00 - 260 (多重線, 9 H)
                                       5.91 (プロード一重般, 2 H)
   357 (一重級,7日)
                                       7.70 (プロードー重線 , 1 日)
   3.67 (プロード一重線, 2 H)
                                  R^1 = H \cdot R^2 = 
   3.93 (一重線, 3 H)
                                     NMR スペクトル (CDCL<sub>5</sub>) ð ppm:
   4.08 (三重線, 2 H; J = 6.0 Hz)
                                      2.00 - 2.40 (多重線, 2 日)
  423 (二重線、1 H; J=140 Hg)
                                   3.53 (一重線,7 H)
   4.57 (二重線,1 H; J=14.0 Hg)
                                   3.65 (プロード一重線,2日)
   507 (一重線,1 H)
                                      365 - 420 (多重線, 4 日)
                                        7.82 (プロード一重額 , 1 日 )
    391 (一重線, 3 日)
                                R^1 = H, R^2 = CH_2CH(CH_5)_2
    417 (二重線,1 H; J=140 Hz)
     4.80 (二重銀, 1 H; J = 140 Hz)
                                     NMRスペクトル (CDCL<sub>3</sub>) δ ppm:
     5.03 (一重線,1日)
                                        0.95 (二重線,6 H; J = 6.0 Hg)
     5.27 (多重線,1日)
                                        155 (一重線,7里)
     5.81 (二重般, 1 H; J = 6.0 Hg)
                                       , 167 (プロード一重線, 2 H)
     5.98 (二重組, 1 H; J = 6.0 Hz)
                                        193 (一重額, 3 日)
     7.87 (プロード一重線,1 H)
                                        198 (二重線, 2 H; J= 6.0 Hg)
 R^1 = H \cdot R^2 = CH_2CH_2CH(CH_5)_2
                                        423 (二重線, 1 B; J = 140 Hg)
   NMR スペクトル (CDCLs) 8 ppm:
                                        457 (二重線,1 H;J=140 Hz)
     0.93 (二重線,6日; J = 60 出 )
                                         5.05 (一重線。1 H)
     1.45 - 1.82 (多重級, 3 日)
                                         590 (プロード一重線, 2 日)
     355 (一重線,7日)
                                        7.57 (プロード一重線、1 日)
     365 (プロード一重線, 2 日)
     3.92 (一重線, 3 H)
                                     R^1 = H , R^2 = -\dot{C} - CH = CH,
```

BMR スペクトル (ODCLs) 8 ppm:

365 (プロードー重銀,2日)

1.57 (一重銀,8m)

357 (一重線,7 H)

422 (三重線, 2 H; J = 60 Hz)

422 (二重級,1 H; J = 14.0 Hg)

455 (二重級,1 H;J=14.0 Hg)

5.88 (プロード一重線,2 日)

5.08 (一重線,1 H)

```
5.05 (一重額, 1 日)
   3.83 (一重線, 8日)
                                          5.82 (プロードー重線, 2 日)
   4.28 (二重線, 1 H; J= 140 Hg)
                                          7.65 (プロード一重銀 , 1 円 )
   458 (二重線,1 H; J=140 Hg)
                                       R^1 = H , R^2 = -
   5.03 (一重線, 1 日)
                                         NMR スペクトル (CDCLs) ð ppm:
   5.12 (プロード二重線 , 1 日; J = 10.0 Hg)
   5.18 (プロード二重線 , 1 日; J = 18.0 Hg)
                                          0.98 (三重線, 6 H; J = 60 Hg)
   5.88 (プロード一重額, 2 円)
                                          1.65 (五重線, 4 H; J = 6.0 Hg)
   8.12 (複二重線 , 1 日; J = 10.0 , 18.0 Hg)
                                          3.57 (一重線,7日)
                                           167 (プロードー重線,2月)
   7.67 (プロード一重額,1 日)
                                           195 (一重般, 3 日)
R^1 = H , R^2 = CH_2
                                           430 (二重級、1 H; J = 140 Hg)
 NMR スペクトル (CDCL<sub>5</sub>) ð ppm:
                                           457 (二重線,1 H; J = 140 Hz)
   1.75 ~ 1.83 (多重額, 6 日)
                                           465 (五重線, 1 H; J = 60 Hz)
   335 - 378 (多重線, 2日)
                                           5.05.(一重線,1日)
   8.55 (一重額,7日)
                                           5.83 (プロード一重線, 2 日)
   3.87 (プロード一重線, 2 日)
                                           7.70 (プロード一重線,1 日)
   388 (一重額, 3 日)
                                      R^{\dagger} = H , R^{2} = CH_{2} 
   405 (二重線,1 H; J=140 Hz)
   412 (多重線, 8 H)
                                        BMR スペクトル (CDCL<sub>5</sub>) 8,ppm:
                                          253 (一重粮,7日)
   457 (二重額, 1 H; J = 140 Hg)
      3.63 (プロード一重線, 2 日)
                                           507 (一重線, 1 日)
                                           5.50 - 6.20 (多重線, 1 日)
      3.93 (一重線, 3 H)
                                           5.93 (プロード一重線, 2 円)
       4.17 (二重線, 1 H; J = 14.0 Hg)
                                           7.77 (プロード一重線,1 日)
       458 (二重線,1 H; J = 140 Hz)
       5.03 (一重線, 1 H)
                                        R^1 = H \cdot R^2 = CH_2CH_2CH_2COCH_5
                                         NMR スペクトル (CDCLs) 8 ppm:
       513 (一重級,2日)
       5.80 (プロード一重線, 2 円)
                                           1.68 - 2.23 (多重線, 2 日)
       6.23 - 6.53 (多重額, 2 日)
                                           2.15 (一重線, 3 H)
                                           2.58 (三重線, 2 H; J = 7.0 Hs)
       7.37 (多重線, 1 日)
                                           3.55 (一重線,7 H)
       7.64 (プロード一重線 , 1 耳)
   R^1 = H , R^2 = -
                                           365 (プロード一重線,2円)
                                           3.93 (一重線, 3 H)
     NMR スペクトル (CDCL) 8 ppm:
       0.9.8 (三重級, 3 H; J = 6.0 Hg)
                                           4.22 (三重版, 2 H; J = 6.0 Hg)
                                           4.22 (二重線, 1 H; J=140 Hg)
      1.10 - 1.97 (多重額, 4 日)
                                           4.58 (二重線, 1 H; J= 140 Bg)
       3.57 (一重線,7日)
       3.67 (プロードー重線, 2 円)
                                           5.05 (一重線,1 H)
                                           5.78 (二重般, 1 H; J = 5.0 Hg)
       393 (一重線, 8 H)
       428 (二重線, 1 H; J = 140 Hg)
                                          5.98 (二重線, 1 H; J = 5.0 Hz)
                                           7.78 (プロードー重般・1 日)
       457 (二重線, 1 H; J = 140 Hg)
```

487 - 5.50 (多重額, 3 日)

```
R^1 = H \cdot R^2 = CH_2CH_2C(CH_5)_8
                                        3.97 (一重線, 3 H)
                                         4.12 (二重線、1 日; J = 14.0 Hz)
 NMR スペクトル (CDCL<sub>5</sub>) & ppm:
                                         4.58 (二重線, 1 H; J = 14.0 Hg)
   0.95 (一重級, 9 日)
                                         4.95 - 5.60 (多重線, 3 日)
   1.62 (三重線, 2 H; J = 7.0 Hz)
                                         5.08 (一重線,1 H)
   3.55 (一重般, 7 H)
                                         5.80 - 8.20 (多重線, 1 日)
   3.65 (プロード一重級; 2 日)
                                         5.97 (プロード一重線, 2 日)
   3.92 (一重線, 3 H)
                                        7.75 (プロード一重線,1 日)
   4.12 (二重線,1 H; J=14.0 Hz)
                                     R^1 = H, R^2 = CH_2CH_2CH_2CH(CH_3)_2
   4.25 (三重線, 2 H; J = 7.0 Hg)
                                       NMR スペクトル (CDCL3) ð ppm:
   455 (二重線、1 H; J= 140 Hz)
                                        0.55 (二重線, 6 H; J = 5.0 Hz)
   5.05 (一重級,1日)
                                        1.05 - 200 (多重線,5 H).
   5.58 (プロード一重線,2月)
                                        3.55 (一重線,7日)
   7.58 (プロードー重線,1 H)
                                         3.65 (プロード一重線,2 H)
R^1 = H , R^2 = -
                                         3.91 (一重線, 3 H)
                                         4.20 (三重線, 2 H; J = 6.0 Hg)
 NMR スペクトル (CDCL<sub>s</sub>) ð ppm:
                                         423 (二重級,1 B; J = 14.0 Bg)
   0.95 (三重線、3 H; J = 8.0 Hz)
                                        4.57 (二重線, 1 H; J = 14.0 Hz)
   1.62 (五重線, 2 H; J = 6.0 Hz)
                                         5.08 (一重額, 1 日)
   3.58 (一重線,7里)
                                         5.88 (プロードー重線, 2 日)
   368 (プロード一重線, 2 日)
                                         3.93 (一重級, 3 H)
    7.13 (プロード一重線, 1 日)
                                         417 (三重線, 2 H; J = 6.0 Hg)
R^1 = H \cdot R^2 = CH_2CH_2CH_2CH_5
                                         423 (二重般, 1 H; J= 148 Hg)
  NMR スペクトル (CDCL5) 8 ppm:
                                         457 (二重線, 1 H; J = 140 Hz)
    0.87 (三重線, 3 H; J = 60 Hz)
                                         5.07 (一重線,1 H)
    1.17 - 1.22 (多重般, 4 H)
                                         583 (一重線, 2 日)
    3.58 (一重級,7 H)
                                       7.67 (プロード一重線。1月)
    3.68 (プロード一重級, 2 H)
    3.97 (一重線, 3 H)
                                      R^1 = H, R^2 = OH_2
    4.20 (二重級, 1 H; J = 140 Hz)
                                        NMR スペクトル (CDCL<sub>5</sub>) 8 ppm:
    4.22 (二重級, 2 H; J = 6.0 Hg.)
                                         0.17 - 1.43 (多重線,5H)
    4.60 (二重級, 1 H; J = 14.0 Hg)
                                          357 (一重線,7日)
    5.08 (一寬線, 1 H)
                                          367 (プロード一重線, 2 日)
    5.95 (プロード一重線, 2 円)
                                          8.93 (一重線, 3 H)
    7.82 (プロード一重線,1 日)
                                          403 (二重額, 2 H; J= 80 Hg)
 R^1 = H, R^2 = CH_2CH_2CH_5
                                          423 (二重級,1 H;J=140 Hg)
   NMR スペクトル (CDCLs) 8 ppm:
                                          440 (二重線, 1 H; J=140 Hg)
    0.97 (三重線, 3 H; J = 6.0 Hz)
                                          5.07 (一重線,1 H)
    1.72 (六重線, 2 H; J = 6.0 Hz)
                                          587 (プロード一重線,2日)
     3.57 (一重級, 7 H)
                                          7.57 (プロード一重線,1 H)
    3.67 (一重線, 2 H)
```

```
450 (二重線,1 H;J=148 Rg)
R^1 = H , R^2 = CH_2CH=CH_2
                                        485 (二重級 , 2 H ; J = 20 Hg )
  NMR スペクトル (CDCLs) 8 ppm:
                                       512 (一重線,18)
    355 (一重線,7日)
                                       5.93 (二重線, 1 H; J = 8.0 Hg)
   365 (プロード一重線,2 H)
                                        6.07 (二重線, 1 H; J = 6.0 Hg)
    3.92 (一重級, 3 日)
                                      7.75 (プロード一重級・1 日)
    418 (二重級,1 H;J=140 Hg)
    4.50 (プロード二重線, 2 H; J = 6.0 \text{ Hz}) R^1 = H, R^2 = \sqrt{\phantom{A}}
    4.55 (二重般, 1 H; J= 140 Hg).
                                      NMR スペクトル (ODCLs) 8 ppm:
    5.02 ~ 5.52 (多重般, 2 日)
                                        1.05 (三重線, 8 H; J = 6.0 Hg)
   5.03 (一重線, 1 H)
                                       1.90 (五重線, 2 H; J = 6.0 Hg)
    5.62 - 6.05 (多重級。1 B)
                                        255 (二重線,1 H; J= 20 Hg)
   .590 (プロード一重線,2 H)
                                        858 (一重額,7日)
    7.57 (プロード一重線 , 1 日 )
                                        388 (プロード一重級, 2 日)
R^1 = H , R^2 = CH_2O = CH
                                        3.97 (一重額, 3 H)
  NMR スペクトル (CDCL<sub>5</sub>) 8 ppm:
                                       427 (二重線, 1 H; J = 140 Hm)
    260 (三重線,1 H; J = 20 Hg)
                                       480 (二重級、1 H; J=140 Hg)
    360 (一重服,7日)
                                       510 (一重般,1日)
    3.70 (プロード一重線, 2 日)
                                        523 ( 複三重線 , 1 H ; J = 20 , 60 Hg )
    3.98 (一重般, 3 H)
                                        802 (プロード一重線,2 日)
    425 (二重級,1 H; J = 140 Hg)
   7.62 (プロード一重線: 1 🛚 )
                                        355 (一重額,7月)
                                        165 (三重線, 2 H; J = 60 Hg)
R^1 = H , R^2 = -
                                        192 (一重線, 3 日)
  NMR スペクトル (UDCL5) 3 ppm:
   1.47 - 230 (多重線, 4 H)
                                        412 (多重級。2 日)
                                        422 (二重線,1 H; J=140 Hg)
   3.58 (一重線, 7 H)
                                        457 (二重線、1 H; J= 140 Hg)
   3.68 (プロード一重線, 2 H)
   873 - 440 (多重線, 4 H)
                                       458 (一重額,2日)
                                        503 (一重線,1 H)
    397 (一重線, 3 日)
   4.23 (二重線, 1 H; J = 140 Hz)
                                       5.80 (二重線, 1 H; J = 6.0 Hg)
                                        588 (プロード多重線, 1 日)
    463 (二重級、1 H; J=140 Hg)
                                        5.90 (二重線, 1 H; J = 6.0 Hg)
    4.63 - 5.08 (多重額, 1 日)
                                      7.15 (プロード一重線 , 1 日 )
    508 (一重線,1 H)
                                   R^1 = CH_5, R^2 = -CH_2(CH_2)_5CH_5
    590 (二重般, 1 H; J = 60 Hg)
                                      NMR スペクトル (CDCLs) 8 ppm:
    603 (二重線,1 H; J = 60 Hg)
                                        0.87 (三重線, 3 H; J = 40 Hg)
    7.78 (一重額,18)
                                       109 - 183 (多重線。10 日)
R^1 = H , R^2 = -CH_2 
                                       1.83 (二重般, 3 H; J = 60 Hg)
                                      853 (一重線,7日)
  NMR スペクトル (CDCL<sub>5</sub>) 8 ppm:
                                       3.62 (プロード一重線, 2日)
    217 (プロード多重線, 2 日)
```

```
588 (プロード多重線, 8 日)
   190 (一重線, 3 H)
                                       873 - 7.10 (多重級,1 日)
   4.20 (二重線, 1 H; J= 140 Hg)
                                       7.63 (プロード一重線 , 1 日 )
   4.22 (三重線, 2 H; J = 6.0 Hg)
                                    R^1 = OH_5, R^2 = OH_2(CH_2)_4CH_3
   4.57 (二重線, 1 H; J= 14.0 Hz)
                                      NMR スペクトル (CDCLs) δ ppm:
   5.02 (一重線,1里).
                                       C87 (三重線, 3 H; J= 6.0 Hg)
   6.92 (四重線, 1 H; J = 6.0 Hg)
                                      1.07 - 200 (多重級,8日)
   7.50 (プロードー重線 , 1 日)
                                       1.82 (二重級, 8 H; J = 60 Hg)
R^1 = CH_5, R^2 = CH_2 - O
                                       351 (一重線,7里)
                                       3.60 (プロード一重線, 2.日)
 NMR スペクトル (CDCLs) 8 ppm:
                                       850 (一重額, 8 H)
   1.80 - 2.30 (多重線, 4 H)
   [ 1.60 (二重線, J = 6.0 Hz ) + 1.65 (二
                                       413 (三重線。2 日; J = 6.0 日 )
   重線 , J = 8.0. Hz ) , 3 H ]
                                       417 (二重級、1日;J=140日8)
                                       457 (二重線,1 B; J=140 Bg)
  353 (一重額, 7日)
                                       5.00 (一重線,1 H)
   3.67 (プロード一重線,2月)
   3.84 (プロード三重線, 2 日)
                                       6.90 (四重線、1 H; J = 6.0 Hg)
                                       7.63 (プロード一重線,1 日)
   893 (一重線, 8日)
                                    R^1 = CH_3, R^2 = CH_2CH_2CH_2CH_3
   4.23 (二重線, 1 H; J= 14.0 Hz)
   457 (二重線、1 H; J=140 Hg)
                                      NMR スペクトル (CDCL<sub>5</sub>) 8 ppm:
                                      . 0.92 (三重般。3 H; J = 40 Hg)
   5.03 (一重線,1 H)
                                       418 (二重線,1 H; J=140 Hg)
      1.85 - 1.92 (多重額 4 日)
                                       458 (二重線, 1 H; J= 140 Hg)
     1.63 (二重線、3 H; J = 60 Hz)
                                       5.00 (一重線, 1 日)
      855 (一重線,7日)
                                       6.90 (四重線, 1 H; J = 5.0 Hg)
      363 (プロード一重線, 2 H)
                                       7.72 (プロード一重線,1 日)
      3.92 (一重線, 3日)
      417 (三重級, 2 H; J = 8.0 Hg)
      420 (二重線,1 H; J = 140 Hg)
                                                    三共株式会社
                                         特許出願人
      460 (二重線, 1 H; J= 140 Hz)
                                                    弁理士 槿 出 庄 治
                                         代 理 人
      502 (一重線, 1 日)
      893 (四重線, 1 H; J = 60 Hg)
      7.72 (プロードー重般, 1 日)
   R^1 = CH_5, R^2 = -CH_2(CH_2)_5 CH_5
     NMR スペクトル (CDCL<sub>2</sub>) δ ppm
      Q88 (三重般, 3 H; J = 60 Hz)
      1.00 - 200 (多重線, 8 H)
      1.81 (二重線, 3 H; J= 50 Hz)
      252 (一重線,7円)
      182 (プロード一重線, 2 日)
      890 (一重線, 3 H)
      413 (三重線, 2 H; J = 60 Hg)
```

手 続 補 正 書 (自 発)

昭和57篇9月2/日

特許庁長官 若杉和 夫殿

1. 事件の表示

昭和 56 年特許願第 146900 号

2. 発明の名称

7-メトキシセフアロスポリン化合物およびその製法

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人 住所 〒103 東京都中央区日本橋本町3丁目1番地の6 名称 (185) 三共株式会社 代表者 取締役社長 河村喜典

4. 代 理 人

居所 〒140 東京都品川区広町1丁目2番58号 三共株式会社内

電話 492-3131

氏名 弁理士 (6007) 樫出庄

5. 補正により増加する発明の数 なし

6. 補正の対象 明細書の発明の名称の欄をよる持許 発明の詳細な説明の欄

7.補正の内容 別紙の通り

1. 明細書館1頁2行目の「発明の名譲」を「発明の名称」と訂正する。

2. 同第6頁1行目の「ジメナルスルホキサイド」を「ジメナルスルホキサイド、N · N · ジメナルスルホキサイド、N · N · ジメナルホルムアミド」と訂正する。

3. 同館7頁2行目の「1.5 乃至2倍モル」を 「1.5 乃至5倍モル」と訂正する。

以上

THIS PAGE BLANK (USPTO)